

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成25年1月17日 (2013.1.17)

【公表番号】特表2012-509903(P2012-509903A)

【公表日】平成24年4月26日 (2012.4.26)

【年通号数】公開・登録公報2012-017

【出願番号】特願2011-537733(P2011-537733)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)
 A 6 1 P 9/14 (2006.01)
 A 6 1 P 19/06 (2006.01)
 A 6 1 P 5/50 (2006.01)
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)
 A 6 1 P 7/10 (2006.01)
 A 6 1 P 9/04 (2006.01)
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/02 (2006.01)
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)
 A 6 1 P 27/16 (2006.01)
 A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/04 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 19/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/437 (2006.01)
 A 6 1 K 31/444 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)
 C 0 7 D 487/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4985 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z
 C 0 7 D 471/04 C S P
 A 6 1 P 3/10

| | | |
|---------|---------|-------|
| A 6 1 P | 3/06 | |
| A 6 1 P | 27/02 | |
| A 6 1 P | 13/12 | |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 9/14 | |
| A 6 1 P | 19/06 | |
| A 6 1 P | 5/50 | |
| A 6 1 P | 3/00 | |
| A 6 1 P | 9/12 | |
| A 6 1 P | 3/04 | |
| A 6 1 P | 7/10 | |
| A 6 1 P | 9/04 | |
| A 6 1 P | 9/10 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 29/00 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 1/16 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |
| A 6 1 P | 37/02 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 2 1 |
| A 6 1 P | 25/18 | |
| A 6 1 P | 25/24 | |
| A 6 1 P | 25/28 | |
| A 6 1 P | 9/10 | |
| A 6 1 P | 25/16 | |
| A 6 1 P | 27/16 | |
| A 6 1 K | 45/00 | |
| A 6 1 P | 25/04 | |
| A 6 1 P | 29/00 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 19/02 | |
| A 6 1 P | 19/08 | |
| A 6 1 K | 31/437 | |
| A 6 1 K | 31/444 | |
| A 6 1 K | 31/496 | |
| A 6 1 K | 31/506 | |
| C 0 7 D | 487/04 | 1 4 0 |
| A 6 1 K | 31/4985 | |
| A 6 1 K | 31/5377 | |
| C 0 7 D | 487/04 | 1 4 4 |

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月21日(2012.11.21)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

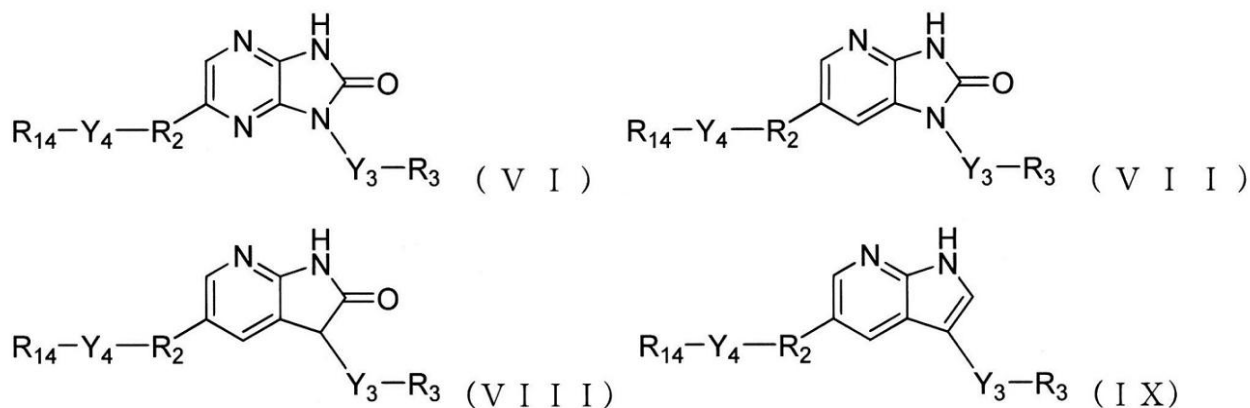
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 V I、式 V I I、式 V I I I、および、式 I X

【化 1】



から選択される構造式を有する化合物またはその塩であって、
式中、

Y_3 は、結合、低級アルキル、低級カルボキシル、および低級ヘテロアルキルから選択され、

Y_4 は、 $C(O)$ 、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_mO-$ 、および $-(CH_2)_mN-$ から選択され、

m は、0 ~ 1 の整数であり、

R_2 は、フェニル、6 員の単環式ヘテロアリール、および 5 / 6 融合二環式ヘテロアリールから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよく、

R_3 は、低級シクロアルキル、フェニル、および低級ヘテロアリールから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよく、

R_{14} は、不在、低級シクロアルキル、低級ヘテロシクロアルキル、フェニル、および低級ヘテロアリールから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよい、化合物またはその塩。

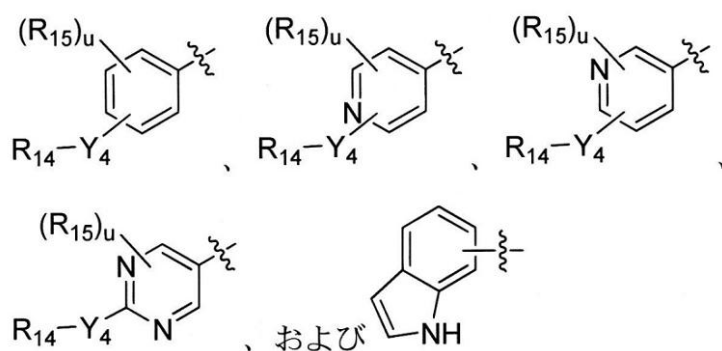
【請求項 2】

R_2 は、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、およびインドリルから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよい、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R_{14}-Y_4-R_2$ の部分は、

【化 2】



から選択され、
式中、

u は、0 ~ 3 の整数であり、

Y_4 は、 $C(O)$ 、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_mO-$ 、および $-(CH_2)_mN-$ から選択され、

各 R_{1-5} は独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 C_1-C_4 アルキル、 C_2-C_4 アルケニル、 C_2-C_4 アルキニル、 C_1-C_4 ハロアルキル、 C_1-C_3 アルコキシ、 C_1-C_3 ハロアルコキシ、低級アミノ、低級アミド、低級スルホンアミド、および低級スルホニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

Y_4 は $-(CH_2)_m-$ であり、

m は 0 であり、

R_{1-4} は存在せず、

u は、1～3 の整数であり、

各 R_{1-5} は独立して、フッ素、ヒドロキシ、 NH_2 、 $NH(CH_3)$ 、 $N(CH_3)_2$ 、 $NS(O)_2CH_3$ 、メトキシ、およびメチルから選択され、あるいは、

Y_4 は $-(CH_2)_m-$ であり、

m は 1 であり、

R_{1-4} は、不在、低級シクロアルキル、低級ヘテロシクロアルキル、フェニル、および低級ヘテロアリールから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよく、

u は、0～2 の整数であり、

各 R_{1-5} は独立して、フッ素、ヒドロキシ、 NH_2 、 $NH(CH_3)$ 、 $N(CH_3)_2$ 、 $NS(O)_2CH_3$ 、メトキシ、およびメチルから選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

各 R_{1-5} は独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、低級アミノ、 C_1-C_3 アルコキシ、および C_1-C_3 アルキルから選択され、 R_{1-4} は、不在、低級ヘテロシクロアルキル、フェニル、および単環式の低級ヘテロアリールから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよい、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

Y_4 は、 $C(O)$ 、 O 、 N 、および $-CH_2-$ から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

Y_3 は、結合および低級アルキルから選択され、好ましくは、 Y_3 は、結合およびメチルから選択され、 R_{1-4} は、不在および任意に置換される低級ヘテロシクロアルキルから選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

Y_3 は、結合およびメチルから選択され、 R_3 は、ハロゲン、ヒドロキシ、低級アミノ、低級アミド、低級フェニルアミド、低級フェニルアルキルアミド、低級ヘテロシクロアルキル、低級ヘテロシクロアルキル、低級アルキルヘテロシクロアルキル、 C_1-C_3 アルコキシ、および C_1-C_3 アルキルから選択される 1 つ以上の置換基で置換される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

Y_4 は $-CH_2-$ である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R_3 は、ベンゾチアゾリル、ピロピリジニル、インダニル、シクロプロピル、シクロペンチル、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、およびインドリルから選択され、それらのいずれも、任意で置換されてもよい、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

Y_3 は結合である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

各 R_{1-5} は独立して、フッ素、ヒドロキシ、 NH_2 、 $NH(CH_3)$ 、 $N(CH_3)_2$ 、メトキシ、およびメチルから選択される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

R_3 は、フッ素、塩素、ヒドロキシ、 NH_2 、 $NH(CH_3)$ 、 $N(CH_3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHCH_3$ 、モルホリノ、ピペラジニル、メチルピペラジニル、アセトアミド、メチルアセトアミド、メチルプロピオンアミド、フェニルアセトアミドメチレン、ベンズアミドメチレン、フェニルプロパンアミドメチレン、メトキシ、およびメチルから選択される 1 つ以上の置換基で置換される、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

実施例 1 ~ 167 から選択される、化合物。

【請求項 15】

薬物として使用するための、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

MLK 媒介性疾患、例えば、真性糖尿病、高血糖、網膜症、腎症、ニューロパチー、潰瘍、微小血管障害および大血管障害、痛風および糖尿病性足部疾患、インスリン抵抗性、メタボリックシンドローム、高インスリン血症、高血圧、高尿酸血症、肥満、浮腫、脂質異常症、慢性心不全、アテローム性動脈硬化、末梢性炎症、癌、ならびに肝炎；鬱病、双極性障害、および心的外傷後ストレス障害（PTSD）などの精神神経障害；脳卒中などの外傷性脳損傷；あるいは、アルツハイマー病（AD）、パーキンソン病、または HIV 関連神経認知障害（HAND）；あるいは、中毒性難聴、難聴、内耳の急性損傷、音響外傷、および発破音に起因する損傷などの聴覚または視覚の神経疾患から選択される MLK 媒介性疾患の処置のための薬物として使用するための、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の化合物を薬学的に許容される担体とともに含む、薬学的組成物。